

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 2003-176217

(43)Date of publication of application : 24.06.2003

(51)Int.Cl.

A61K 7/48

A61K 7/00

(21)Application number : 2001-378945

(71)Applicant : SHOWA DENKO KK

(22)Date of filing : 12.12.2001

(72)Inventor : KATO EIKO
TSUZUKI SATOSHI
OGATA EIJI

(54) SKIN CARE PREPARATION

(57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To provide a skin care preparation improved in both the solubility and emulsifiability of an ascorbic acid-2-phosphoric ester's higher fatty acid ester salt as its active ingredient so as to efficiently transform the salt into the activated type in the skin tissue, and to provide a cosmetic containing the same.

SOLUTION: This skin care preparation contains the ascorbic acid-2- phosphoric ester's higher fatty acid ester salt and has a pH of 7-9. The cosmetic containing the same is also provided.

LEGAL STATUS

[Date of request for examination] 05.08.2004

[Date of sending the examiner's decision of rejection] 27.09.2005

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開2003-176217

(P 2 0 0 3 - 1 7 6 2 1 7 A)

(43) 公開日 平成15年6月24日 (2003.6.24)

(51) Int. Cl. ⁷	識別記号	F I	テ-マコ-ト (参考)
A61K 7/48		A61K 7/48	4C083
7/00		7/00	D

審査請求 未請求 請求項の数 9 O L (全5頁)

(21) 出願番号 特願2001-378945 (P 2001-378945)

(22) 出願日 平成13年12月12日 (2001.12.12)

(71) 出願人 000002004

昭和電工株式会社

東京都港区芝大門1丁目13番9号

(72) 発明者 加藤 詠子

千葉県千葉市緑区大野台一丁目1番1号

昭和電工株式会社総合研究所内

(72) 発明者 続木 敏

千葉県千葉市緑区大野台一丁目1番1号

昭和電工株式会社総合研究所内

(74) 代理人 100118740

弁理士 柿沼 伸司

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 皮膚外用剤

(57) 【要約】

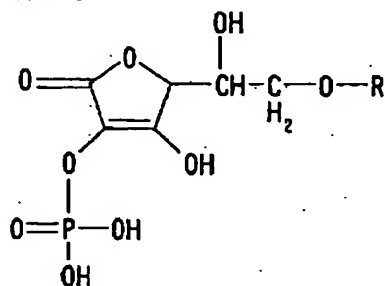
【課題】 皮膚外用剤におけるアスコルビン酸-2-リン酸エステルの高級脂肪酸エステル塩の溶解性、乳化性を改善し、皮膚組織内で活性型への変換が効率的に行われる皮膚外用剤及びそれを含有する化粧料を提供すること。

【解決手段】 アスコルビン酸-2-リン酸エステルの高級脂肪酸エステル塩を含有し、pHが7~9であることを特徴とする皮膚外用剤およびそれを含有する化粧料。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記一般式(1)

【化1】



(1)

(式中Rは、高級脂肪酸残基を表わす。)で示されるアスコルビン酸-2-リン酸エステル的高级脂肪酸エステルの塩を含有し、pHが7~9であることを特徴とする皮膚外用剤。

【請求項2】 上記一般式(1)のRがラウリン酸、ミリスチン酸、パルミチン酸またはステアリン酸の残基であることを特徴とする請求項1に記載の皮膚外用剤。

【請求項3】 上記一般式(1)のRがパルミチン酸の残基であることを特徴とする請求項1または2に記載の皮膚外用剤。

【請求項4】 アスコルビン酸-2-リン酸エステルの高级脂肪酸エステルの塩が、Na塩、K塩、Mg塩またはZn塩である請求項1ないし3のいずれかに記載の皮膚外用剤。

【請求項5】 アスコルビン酸-2-リン酸エステルの高级脂肪酸エステルの塩を0.01~20質量%含有することを特徴とする請求項1ないし4のいずれかに記載の皮膚外用剤。

【請求項6】 pH調整剤を含有することを特徴とする請求項1ないし5のいずれかに記載の皮膚外用剤。

【請求項7】 pH調整剤として、クエン酸、コハク酸、グリコール酸、酒石酸、乳酸、アスパラギン酸、グルタミン酸、リン酸、炭酸及びそれらのナトリウム塩、トリエタノールアミン、トリエタノールアミンならびにジエタノールアミンからなる群より選択された少なくとも1種以上を用いることを特徴とする請求項6に記載の皮膚外用剤。

【請求項8】 pH調整剤の含有量が、0.01~10質量%の範囲である請求項6または7に記載の皮膚外用剤。

【請求項9】 請求項1ないし8のいずれかに記載の皮膚外用剤を含有してなる化粧料。

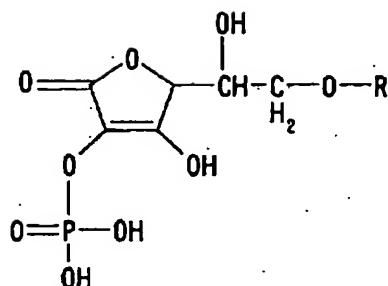
【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】 本発明は、下記一般式(1)

【0002】

【化2】



(1)

10 【0003】 (式中Rは、高級脂肪酸残基を表わす。)で表されるアスコルビン酸誘導体の塩を含有し、安定性、溶解性に優れた皮膚外用剤に関する。

【0004】

【従来の技術】 アスコルビン酸およびその種々の誘導体は、美白作用、抗酸化作用、コラーゲン合成促進作用等の効能効果を呈する化合物として知られており、医薬品、化粧品、飼料等に配合されている。

【0005】 このアスコルビン酸誘導体のうち、2位の水酸基をリン酸エステル化し6位を高級脂肪酸エステル化した化合物およびその塩は、酸化され難く安定で、両親媒性であるがゆえに生体への親和性が高められた誘導体で皮膚等の生体組織への移行が速やかであり、その医薬品、化粧品、試料等への適用が期待されている。

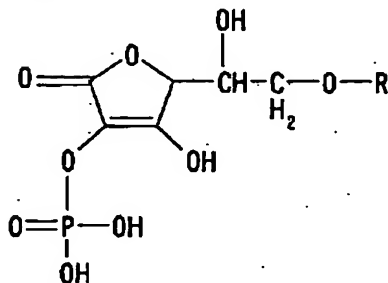
【0006】 しかしこれらの誘導体を水溶液とすると、pHが弱酸性~酸性の領域においては、化学的に不安定となり、また溶解性が低下してしまうために生体組織への移行性が損なわれてしまうので、これを安定した形で含有する皮膚外用剤の創生が求められていた。

【0007】

30 【発明が解決しようとする課題】 本発明はアスコルビン酸誘導体のうち、下記一般式(1)

【0008】

【化3】



(1)

【0009】 (式中Rは、高級脂肪酸残基を表わす。)で表されるアスコルビン酸-2-リン酸エステルの高级脂肪酸エステルの塩の安定性、溶解性を高めた皮膚外用剤を提供することにある。

【0010】

【課題を解決するための手段】 本発明者らは、上記課題を解決すべく鋭意検討した結果、最終pHが7~9である皮膚外用剤が有用であることを見出し、本発明を完成

するに至った。

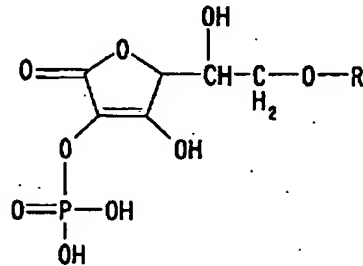
【0011】さらに、本発明者らは、皮膚外用剤の最終pHを7～9にすることにより、アスコルビン酸-2-リン酸エステルの高級脂肪酸エステルの塩が均一に溶解し、皮膚組織内に効率的に移行することを見出し、本発明を完成するに至った。

【0012】すなわち、本発明は以下の事項に関する。

【1】下記一般式(1)

【0013】

【化4】



【0014】(式中Rは、高級脂肪酸残基を表わす。)で示されるアスコルビン酸-2-リン酸エステルの高級脂肪酸エステルの塩を含有し、pHが7～9であることを特徴とする皮膚外用剤。

【2】上記一般式(1)のRがラウリン酸、ミリスチン酸、パルミチン酸またはステアリン酸の残基であることを特徴とする上記【1】に記載の皮膚外用剤。

【0015】【3】上記一般式(1)のRがパルミチン酸の残基であることを特徴とする上記【1】または

【2】に記載の皮膚外用剤。

【4】アスコルビン酸-2-リン酸エステルの高級脂肪酸エステルの塩が、Na塩、K塩、Mg塩またはZn塩である上記【1】ないし【3】のいずれかに記載の皮膚外用剤。

【0016】【5】アスコルビン酸-2-リン酸エステルの高級脂肪酸エステルの塩を0.01～20質量%含有することを特徴とする上記【1】ないし【4】のいずれかに記載の皮膚外用剤。

【6】pH調整剤を含有することを特徴とする上記

【1】ないし【5】のいずれかに記載の皮膚外用剤。

【0017】【7】pH調整剤として、クエン酸、コハク酸、グリコール酸、酒石酸、乳酸、アスパラギン酸、グルタミン酸、リン酸、炭酸及びそれらのナトリウム塩、トリエタノールアミン、トリイソプロパノールアミンならびにジイソプロパノールアミンからなる群より選択された少なくとも1種以上を用いることを特徴とする上記【6】に記載の皮膚外用剤。

【8】pH調整剤の含有量が、0.01～10質量%の範囲である上記【6】または【7】に記載の皮膚外用剤。

【9】上記【1】ないし【8】のいずれかに記載の皮膚外用剤を含有してなる化粧料。

【0018】

【発明の実施の形態】本発明の含有成分であるアスコルビン酸-2-リン酸エステルの高級脂肪酸エステルの塩について説明する。

【0019】前記一般式(1)におけるRの定義にみられる高級脂肪酸とは、ラウリン酸、ミリスチン酸、パルミチン酸、ステアリン酸などを挙げることができるが、最も好ましいものは、パルミチン酸である。

【0020】本発明に使用されるアスコルビン酸-2-リン酸エステルの高級脂肪酸エステルの塩は、アスコルビン酸の2位にリン酸がエステル結合し、6位に高級脂肪酸がエステル結合し、そのリン酸エステルのリン酸基と塩基とで塩を形成した化合物である。

【0021】高級脂肪酸エステル塩として、好ましいものを挙げれば、Na塩、K塩、Mg塩、Zn塩などを挙げることができるが、最も好ましいのはNa塩である。

【0022】本発明の皮膚外用剤において、アスコルビン酸-2-リン酸エステルの高級脂肪酸エステルの塩の配合量は0.01～20質量%、より好ましくは0.05～12質量%である。

【0023】本発明の皮膚外用剤において使用できるpH調整剤としては、通常皮膚外用剤に配合されるものであれば特に限定はなく、例えば、クエン酸、コハク酸、グリコール酸、酒石酸、乳酸、アスパラギン酸、グルタミン酸、リン酸、炭酸などの酸性物質；そのナトリウム塩；トリエタノールアミン、トリイソプロパノールアミン、ジイソプロパノールアミンなどの中和剤等が挙げられる。

【0024】pH調整剤の配合量は、得られる皮膚外用剤の最終pHを7～9に調整するに適した量であればよく、好ましくは0.01～10質量%、より好ましくは0.05～5質量%である。

【0025】本発明は、アスコルビン酸-2-リン酸エステルの高級脂肪酸エステルの塩を含有してなる皮膚外用剤に関するものであるが、皮膚外用剤として最も多いのは化粧料であり、例えばスキンミルク、スキนครリーム、ファンデーションクリーム、マッサージクリーム、クレンジングクリーム、シェービングクリーム、クレンジングフォーム、化粧水、ローション、パック、シャンプー、リンス、育毛剤、養毛剤、染毛剤、整髪料、歯磨、うがい剤、パーマメントウェーブ剤、軟膏、入浴剤、ボディークリーム等が広義には含まれ、使用時に皮膚に接触させるものなら種類を問わない。また使用者の性別、老若を問わない。

【0026】また、本発明の皮膚外用剤には、本発明の効果を損なわない範囲で、一般に皮膚外用剤に用いられる成分を配合することができる。

【0027】

【実施例】以下、実施例により本発明を詳細に説明するが、本発明はこれら実施例になら限定されるものでは

ない。

【0028】測定方法

1) pH測定条件

測定にはガラス電極式水素イオン濃度計(堀場製作所製、F-13)を用い、常法により行った。

【0029】2) 液体クロマトグラフィー測定条件

カラム: 昭和電工株式会社製 Shodex (昭和電工株式会社登録商標) C18P 4E

カラム温度: 40℃

溶離液: 0.1Mリン酸水素ナトリウム(pH7.0)
/テトラヒドロフラン=65/35

流速: 0.7ml/分

検出: UV265nm

なお、実施例中の配合量は質量%を表す。

【0030】

実施例1~2、及び比較例1~2

ローション

実施例1~2 比較例1~2

1) アスコルビン酸-2-リン酸-6-パルミチン酸ナトリウム

2.00 -

2) クエン酸

0.08 0.15

3) トリエタノールアミン

0.05 0.40

4) エタノール

5.00 5.00

5) プロピレングリコール

5.00 5.00

6) パラヒドロキシ安息香酸メチル

0.20 0.20

7) 精製水

87.8 87.8

【0031】(実施例1~2の製造方法) 1) 及び4) ~7) を均一に分散溶解し、攪拌しながら2) を添加し pH7のローション(実施例1) を、又は3) を添加し pH9のローション(実施例2) を得る。

(比較例1~2の製造方法) 1) 及び4) ~7) を均一に分散溶解し、攪拌しながら2) に添加し pH6のローション(比較例1) を、又は3) を添加し pH10のローション(比較例2) を得る。

【0032】(結果) 実施例1~2、比較例1~2で得られたローションを40℃で静置し、アスコルビン酸-

実施例3~4、及び比較例3~4

乳液

実施例3~4 比較例3~4

1) アスコルビン酸-2-リン酸-6-パルミチン酸ナトリウム

5.00 -

2) クエン酸

0.08 0.15

3) トリエタノールアミン

0.05 0.40

4) プロピレングリコール

10.0 10.0

5) パラヒドロキシ安息香酸メチル

0.20 0.20

6) メチルフェニルポリシロキサン

20.0 20.0

7) 精製水

64.8 64.8

【0034】(実施例3~4の製造方法) 1) 及び2) 又は3) 及び4) ~5) を7) に均一に分散溶解し、攪拌しながら6) に添加し pH7の乳液(実施例3) 又は pH9の乳液(実施例4) を得る。

(比較例3~4の製造方法) 1) 及び2) 又は3) 及び4) ~5) を7) に均一に分散溶解し、攪拌しながら6) に添加し pH6の乳液(比較例3) 又は pH10の乳液(比較例4) を得る。

【0035】(結果) 実施例3~4、比較例3~4で得られた乳液を40℃で静置し、アスコルビン酸-2-リ

ン酸-6-パルミチン酸ナトリウムの残存量を経時的に調べた。アスコルビン酸-2-リン酸-6-パルミチン酸ナトリウムの定量は高速液体クロマトグラフィーを用いて行った。40℃静置1ヵ月後、アスコルビン酸-2-リン酸-6-パルミチン酸ナトリウムの残存量は、実施例3~4ではいずれも初発の約98%であったが、比較例3~4ではいずれも初発の約74%であり、かつ沈殿・着色が観察された。

【0036】

実施例 5 ～ 6、及び比較例 5 ～ 6

乳液

実施例 5 ～ 6 比較例 5 ～ 6

1) アスコルビン酸-2-リン酸-6-パルミチン酸ナトリウム

5. 0 0 -

2) クエン酸

0. 0 8 0. 1 5

3) トリエタノールアミン

0. 0 5 0. 4 0

4) 水素添加大豆リン脂質

10. 0 10. 0

5) パラヒドロキシ安息香酸メチル

0. 2 0 0. 2 0

6) 2-エチルヘキサン酸トリグリセリド

20. 0 20. 0

7) 精製水

62. 8 62. 8

【0037】（実施例 5 ～ 6 の製造方法）1）及び 2）又は 3）及び 4）～ 5）を 7）に均一に分散溶解し、攪拌しながら 6）に添加し pH 7 の乳液（実施例 5）又は pH 9 の乳液（実施例 6）を得る。

（比較例 5 ～ 6 の製造方法）1）及び 2）又は 3）及び 4）～ 5）を 7）に均一に分散溶解し、攪拌しながら 6）に添加し pH 6 の乳液（比較例 5）又は pH 10 の乳液（比較例 6）を得る。

【0038】（結果）実施例 5 ～ 6、比較例 5 ～ 6 で得られた乳液を 40℃で静置し、アスコルビン酸-2-リン酸-6-パルミチン酸ナトリウムの残存量を経時的に調べた。アスコルビン酸-2-リン酸-6-パルミチン

酸ナトリウムの定量は高速液体クロマトグラフィーを用いて行った。40℃静置 1 ヶ月後、アスコルビン酸-2-リン酸-6-パルミチン酸ナトリウムの残存量は、実施例 5 ～ 6 ではいずれも初発の約 96%であったが、比較例 5 ～ 6 ではいずれも初発の約 75%であり、かつ沈殿・着色が観察された。

【0039】

【発明の効果】本発明の皮膚外用剤は、pH を 7 ～ 9 に調整することにより、皮膚外用剤としたとき剤中で安定であり、化粧料を含み皮膚外用剤全般に有用に用いることができる。

フロントページの続き

(72)発明者 小方 英二
千葉県千葉市緑区大野台一丁目 1 番 1 号
昭和電工株式会社総合研究所内

Fターム(参考) 4C083 AB281 AB311 AC102 AC122
AC301 AC302 AC422 AC482
AC541 AC542 AC581 AC582
AD162 AD572 AD641 AD642
CC04 CC05 DD23 DD31 EE01